

⑩ Patent Application Public notice 1970-11132
44 Public Notice Date April 22, 1970
54 TITLE Aliphatic SH - The synthetic method for anilide.
72 INVENTOR Toshizi Fukumaru
Noritaka Hanma
Tadashi Nakatani
Hideaki Fukushima
Katsuyuki Dohi
71 APPLICANT Sumitomo Chemical company

Assignee Yukio Sawaura
21 Patent 1967-568
22 Application Date December 28, 1966

Abstract Summary

- This patent is to cover the synthetic method for Aliphatic SH , anilide.
- Two reaction materials for this reaction are
 - 1) Higher fatty acid as showing the following
RCOOH : R means the saturated or unsaturated aliphatic group containing
up to $C_{15} \sim C_{25}$. with/without OH group and/or with/without
branch
 - 2) Aniline derivative, which is having SH group
- This reaction is the dehydrated condensation reaction with heating treatment.
- The compounds indicating in this application were synthesized by the said
reaction and were newly synthesized compounds, which were not published in
any manuscripts. It was also shown that this group of compounds has the
prevention effect for atherosclerosis(the detail was not described).

1

2

⑤脂肪族SH-アニリドの製法

①特 願 昭42-568

②出 願 昭41(1966)12月28日

⑦発 明 者 福丸俊次

京都市東山区山科御陵別所町65

同 半間範隆

西宮市甲子園口3の28の16

同 仲谷坦

豊中市曾根東町2の66

同 福島英明

高槻市登美の里町18の19

同 土岐克之

西宮市甲子園口2の9の7

⑦出 願 人 住友化学工業株式会社

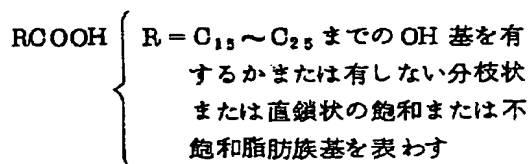
大阪市東区北浜5の15

代 表 者 長谷川周重

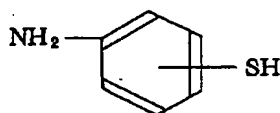
代 理 人 弁理士 沢浦雪男

発明の詳細な説明

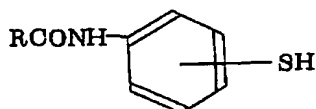
本発明は次の一般式



にて示される高級脂肪酸と次の一般式



にて示されるSH基を有するアニリン誘導体とを、加熱的に脱水縮合せしむることを特徴とする次の一般式

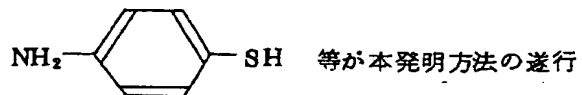
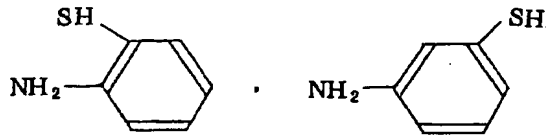


にて示される脂肪族SH-アニリドの製法に係り、その目的とする所は著効を有する動脈硬化防止剤の安価且つ工業的有利な製法を提供するにある。

本発明方法に含有される物質は、全て本発明者等により初めて合成された文献未記載の新規化合物であり、本アミド化合物群は極めて優れた動脈硬化防止作用のあることが判明した。

脂肪酸(RCOOH)については $\text{R} = \text{C}_{15} \sim \text{C}_{25}$ 迄のOH基を有するかまたは有しない分枝状または直鎖状の飽和および不飽和脂肪酸で下記に例示する脂肪酸を代表例とするものであるが、勿論これら以外の脂肪酸でもRの範囲に包含されるものは全て本発明方法中に含有されるべきである。飽和脂肪酸としてはパルミチン酸、ステアリン酸、
15 イソステアリン酸、アラキシン酸、ベヘン酸、リグノセリン酸、ペンタコサン酸、ヘキサコサン酸、不飽和脂肪酸としては、パルミトオレイン酸、ゾーマリン酸、オレイン酸、ペトロセリン酸、エライジン酸、バクセン酸、ガドレン酸、エルカ酸、
20 ブラシジン酸、セラコレイン酸、リノール酸、リノエライジン酸、リシノール酸、エリオステアリン酸、リノレン酸、バリナリン酸、アイコサテトラエン酸、アラキドン酸、アイコサペンタエン酸、ドコサペンタエン酸等の単独または混合の状態、
25 或は以下に記す天然油脂の加水分解酸または簡単に固体酸と液体酸とを分離した液体酸でもよい。即ち麻実油、アマニ油、エコマ油、オイチシカ油、カヤ油、クルミ油、ケシ油、サフラワ油、スイカ種油、大豆油、ヒマワリ油、ヌカ油、カボチャ種油、コウ
30 リヤン油、ゴマ油、トウモロコシ油、ナタネ油、綿実油、オリーブ油、カシユー実油、ツバキ油、バツカク油、ヒマシ油、落花生油、パーム油、パーム核油、ヤシ油、牛脂、豚脂、骨油、馬油、イナゴ油、サナギ油、サメ油、イカ油、イワシ油、
35 サバ油、サンマ油、ニシン油、アジ油、タラ油、マス油、ボラ油、マグロ油、メヌケ油、メンヘーデン油、ウナギ油、カレイ油、クジラ油、肝油、残油等の脂肪酸である。

次に本反応の原料の一つであるアミンに就て説明するならば以下の如き、アミンすなわち、



に当たつて使用される。

次に本発明方法に含有される反応の態様を説明するならば、以下の通りである。

即ち上記脂肪酸と当モルまたは若干過剰のアニリン誘導体を加え、両者を100～300℃迄の温度で、1時間から100時間程度加熱し、此の間副生する水を必要に応じて反応系外に駆逐しながら反応を進行せしむることが出来る。また必要に応じてオートクレーブ中高温に加熱して反応時*20

*間を短縮せしめ目的物を得ることも出来る。

反応終了後、反応生成物を常法通り酸洗、アルカリ洗、水洗、乾燥等の処理を行い蒸留または再結晶すれば目的物が得られるが、大抵の場合は直ちに蒸留精製することに依り、目的物を精製し得る。

以下実施例に就て詳細な説明を行う。

実施例 1

10g リノール酸と6g o-アミノチオフェノールを混じ反応中副生する水を反応系外に駆逐しながら180℃に24時間加熱する。反応終了後直ちに蒸留を行う。

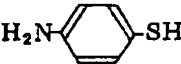
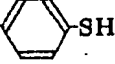
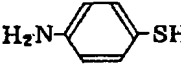
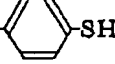
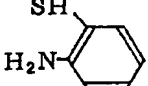

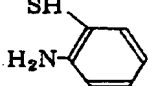

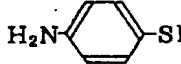
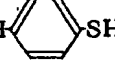
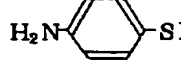
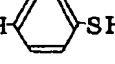
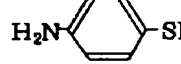
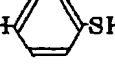
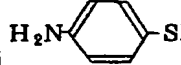
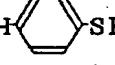
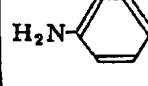

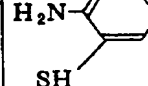

b. p. 203～211℃ / 0.07mmHg 11.3g

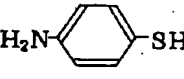
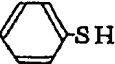
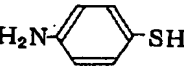
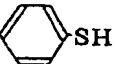
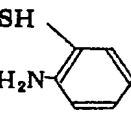
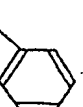

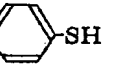
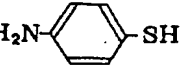
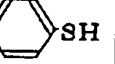
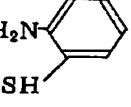

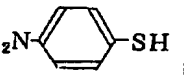
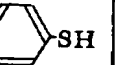
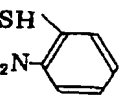

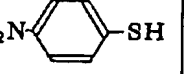
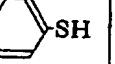
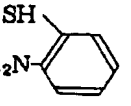

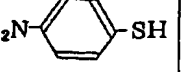
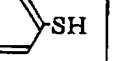
元素分析 理論値(%) 分析値(%)

C	74.38	74.44
H	9.62	9.73
N	3.61	3.42

以下表をもつて実施例を示す。

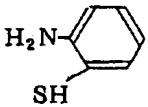
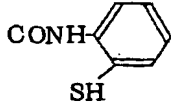
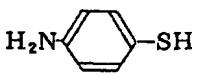
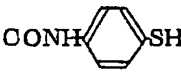
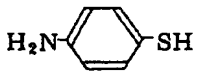
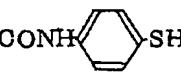
実施例	酸	アミン部	反応時間	反応温度	b. p. °C	mmHg	アミン構造	C %		H %		N %	
								理論	分析	理論	分析	理論	分析
2	リノール酸		18	180	198-204	0.05		74.38	74.43	9.62	9.66	3.61	3.47
3			20	180	200-208	0.05		74.38	74.52	9.62	9.78	3.61	3.39
4			20	170	200-205	0.05		74.38	74.49	9.62	9.77	3.61	3.31
5	オレイン酸		20	175	200-206	0.05		73.99	74.10	10.08	10.21	3.60	3.40
6	イソステアリン酸		20	150	200-211	0.05		73.61	73.81	10.55	10.76	3.58	3.52
7	リノレン酸		20	170	201-208	0.05		74.76	74.92	9.15	9.33	3.63	3.41

実施例	酸	アミン部	反応時間	反応温度	b. p. °C	mmHg	アミド構造
8	大豆油酸		20	170	188-211	0.06	大豆油 CONH- 
9	サフラワ油酸		20	170	190-209	0.05	サフラワ油 CONH- 
10	ゴマ油酸		20	170	196-210	0.05	ゴマ油 CONH- 
11	ヒマシ油酸		20	170	195-208	0.06	ヒマシ油 CONH- 
12	綿実油酸		20	170	200-213	0.06	綿実油 CONH- 
13	糠油酸		20	165	193-208	0.05	糠油 CONH- 
14	ヒマワリ油酸		20	165	198-211	0.04	ヒマワリ油 CONH- 
15	アマニ油酸		20	170	195-208	0.03	アマニ油 CONH- 
16	トウモロコシ油酸		20	160	196-217	0.05	トウモロコシ油 CONH- 
17	ナタネ油酸		20	170	196-216	0.05	ナタネ油 CONH- 

実施例	酸	アミン部	反応時間	反応温度	b. p. °C	mmHg	アミド構造
18	オリーブ油酸		20	170	199-213	0.04	オリーブ油 CONH- 
19	イカ油酸		20	160	188-219	0.05	イカ油 CONH- 
20	イワシ油酸		20	170	194-217	0.05	イワシ油 CONH- 
21	サバ油酸		18	170	188-217	0.06	サバ油 CONH- 
22	サンマ油酸		18	175	193-211	0.07	サンマ油 CONH- 
23	ニシン油酸		20	175	184-213	0.06	ニシン油 CONH- 
24	アジ油酸		20	170	188-218	0.05	アジ油 CONH- 
25	タラ油酸		20	170	190-215	0.07	タラ油 CONH- 
26	マグロ油酸		18	170	188-208	0.05	マグロ油 CONH- 
27	メンヘーデン油酸		18	170	190-210	0.05	メンヘーデン油 CONH- 
28	カレイ油酸		20	170	196-213	0.06	カレイ油 CONH- 

9

10

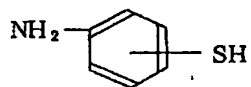
29	メヌケ油		18	170	196-218	0.06	メヌケ油	
30	クジラ油		20	165	188-215	0.05	クジラ油	
31	残油酸		20	160	198-218	0.06	残油	

特許請求の範囲

1 一般式

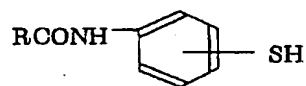


(R = C₁₅ ~ C₂₅ までの OH 基を有するかまたは有しない分枝状または直鎖状の飽和または不飽和脂肪族基を表わす) にて示される高級脂肪酸と次の一般式



にて示される SH 基を有するアニリン誘導体とを加熱的に脱水縮合せしむることを特徴とする次の

15 一般式



20 にて示される脂肪族 SH - アニリドの製法。